

# PATENT COOPERATION TREATY

From the INTERNATIONAL BUREAU

**PCT**

## NOTIFICATION OF ELECTION

(PCT Rule 61.2)

To:

Commissioner  
US Department of Commerce  
United States Patent and Trademark  
Office, PCT  
2011 South Clark Place Room  
CP2/5C24  
Arlington, VA 22202  
ETATS-UNIS D'AMERIQUE  
in its capacity as elected Office

<b>Date of mailing (day/month/year)</b> 23 January 2001 (23.01.01)	
<b>International application No.</b> PCT/EP00/04938	<b>Applicant's or agent's file reference</b> 6713Wiar9961
<b>International filing date (day/month/year)</b> 30 May 2000 (30.05.00)	<b>Priority date (day/month/year)</b> 04 June 1999 (04.06.99)
<b>Applicant</b> KRUSE, Inge et al	

1. The designated Office is hereby notified of its election made:

☒ in the demand filed with the International Preliminary Examining Authority on:  
08 December 2000 (08.12.00)

☐ in a notice effecting later election filed with the International Bureau on:  
\_\_\_\_\_

2. The election ☒ was

☐ was not

made before the expiration of 19 months from the priority date or, where Rule 32 applies, within the time limit under Rule 32.2(b).

<b>The International Bureau of WIPO</b> 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland	<b>Authorized officer</b>  Charlotte ENGER
Facsimile No.: (41-22) 740.14.35	Telephone No.: (41-22) 338.83.38

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
14. Dezember 2000 (14.12.2000)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 00/74641 A1**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: A61K 7/42,  
A61P 17/16, A61K 7/48

[DE/DE]; Schlüterstrasse 3, D-20146 Hamburg (DE).  
RIPPKE, Frank [DE/DE]; Jugendstrasse 3, D-22527  
Hamburg (DE). SCHÖNROCK, Uwe [DE/DE]; Lerchen-  
weg 33, D-23866 Nahe (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP00/04938

(22) Internationales Anmeldedatum:  
30. Mai 2000 (30.05.2000)

(74) Gemeinsamer Vertreter: BEIERSDORF AG; Unnas-  
trasse 48, D-20245 Hamburg (DE).

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(81) Bestimmungsstaaten (*national*): JP, US.

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): europäisches Patent (AT,  
BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC,  
NL, PT, SE).

(30) Angaben zur Priorität:  
199 25 499.0 4. Juni 1999 (04.06.1999) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme  
von US): BEIERSDORF AG [DE/DE]; Unnastrasse 48,  
D-20245 Hamburg (DE).

**Veröffentlicht:**

— Mit internationalem Recherchenbericht.

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes, und der anderen  
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on  
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe  
der PCT-Gazette verwiesen.

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): KRUSE, Inge

(54) Title: USE OF ASCORBIC ACID AND ONE OR MORE FLAVONE DERIVATIVES AND/OR FLAVAN DERIVATIVES,  
ESPECIALLY FLAVONOIDS, FOR PRODUCING COSMETIC OR DERMATOLOGICAL PREPARATIONS USED TO PRE-  
VENT OR SOOTH SUNBURNS

(54) Bezeichnung: VERWENDUNG VON ASCORBINSÄURE UND EINEM ODER MEHREREN FLAVONDERIVATEN  
UND/ODER FLAVANONDERIVATEN, INSBESONDERE FLAVONOIDEN ZUR HERSTELLUNG KOSMETISCHER ODER  
DERMATOLOGISCHER ZUBEREITUNGEN ZUR PROPHYLAXE ODER LINDERUNG DES SONNENBRANDES

(57) Abstract: The invention relates to the use of ascorbic acid and ascorbyl compounds and one or more flavone derivatives and/or  
flavan derivatives, especially flavonoids, for producing a cosmetic or dermatological preparation used to prevent or sooth sunburns.

(57) Zusammenfassung: Verwendung von Ascorbinsäure und/oder Ascorbylverbindungen und einem oder mehreren Flavonderi-  
vaten und/oder Flavanonderivaten, insbesondere Flavonoiden zur Herstellung kosmetischer oder dermatologischer Zubereitung zur  
Prophylaxe oder Linderung des Sonnenbrandes.



WO 00/74641 A1

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

**Biersdorf Aktiengesellschaft  
Hamburg**

5

**Beschreibung**

**Verwendung von Ascorbinsäure und einem oder mehreren Flavonderivaten  
und/oder Flavanonderivaten, insbesondere Flavonoiden zur Herstellung  
10 kosmetischer oder dermatologischer Zubereitungen zur Prophylaxe oder Linderung  
des Sonnenbrandes**

Die vorliegende Erfindung betrifft kosmetische und dermatologische Zubereitungen.

15 Die schädigende Wirkung des ultravioletten Teils der Sonnenstrahlung auf die Haut ist allgemein bekannt. In Abhängigkeit von ihrer jeweiligen Wellenlänge haben die Strahlen verschiedene Wirkungen auf das Organ Haut: Die sogenannte UV-C-Strahlung mit einer Wellenlänge, die kleiner als 290 nm ist, wird von der Ozonschicht in der Erdatmosphäre absorbiert und hat daher keine physiologische Bedeutung. Dagegen verursachen Strahlen im Bereich zwischen 290 nm und 320 nm, dem sogenannten UV-B-Bereich, ein Erythem, einen einfachen Sonnenbrand oder sogar mehr oder weniger starke Verbrennungen.

25 Der Sonnenbrand (*Erythema solare*) stellt somit eine akute Lichtdermatose dar. Er ist eine phototraumatische Reaktion bei an sich normaler Lichtempfindlichkeit der Haut durch Überdosierung von UV-Licht. Die Symptome des Sonnenbrandes sind mehr oder starke Hautrötung und eventuell Blasenbildung. Im Verlaufe der Abheilung des Sonnenbrandes ist oftmals Abschuppung der lichtexponierten Hautbereiche zu beobachten.

30 Als ein Maximum der Erythemwirksamkeit des Sonnenlichtes wird der engere Bereich um 308 nm angegeben.

Man hat lange Zeit fälschlicherweise angenommen, daß die langwellige UV-A-Strahlung mit einer Wellenlänge zwischen 320 nm und 400 nm nur eine vernachlässigbare biologisch Wirkung aufweist und daß dementsprechend die UV-B-Strahlen für die meisten Lichtschäden an der menschlichen Haut verantwortlich seien. Inzwischen ist allerdings

**BESTÄTIGUNGSKOPIE**

durch zahlreiche Studien belegt, daß UV-A-Strahlung im Hinblick auf die Auslösung photodynamischer, speziell phototoxischer Reaktionen und chronischer Veränderungen der Haut weitaus gefährlicher als UV-B-Strahlung ist. Auch kann der schädigende Einfluß der UV-B-Strahlung durch UV-A-Strahlung noch verstärkt werden.

5

Etwa 90 % der auf die Erde gelangenden ultravioletten Strahlung besteht aus UV-A-Strahlen. Während die UV-B-Strahlung in Abhängigkeit von zahlreichen Faktoren stark variiert (z.B. Jahres- und Tageszeit oder Breitengrad), bleibt die UV-A-Strahlung unabhängig von jahres- und tageszeitlichen oder geographischen Faktoren Tag für Tag relativ konstant. Gleichzeitig dringt der überwiegende Teil der UV-A-Strahlung in die lebende Epidermis ein, während etwa 70 % der UV-B-Strahlen von der Hornschicht zurückgehalten werden.

10

Ein Sonnenbad wird von den meisten Menschen als angenehm empfunden, die nachteiligen Folgen zunächst nicht beachtet. Allerdings hat sich in den letzten Jahren durchaus ein Bewußtsein über die negativen Auswirkungen einer zu intensiven Sonnenbestrahlung herausgebildet, weshalb mehr und stärker schützende Sonnenschutzmittel angewendet werden. Zum Schutz gegen UV-B-Strahlung als Prophylaxe des Sonnenbrandes sind zahlreiche Verbindungen bekannt, bei denen es sich zumeist um Derivate des 3-Benzylidencamphers, der 4-Aminobenzoessäure, der Zimtsäure, der Salicylsäure, des Benzophenons sowie auch des 2-Phenylbenzimidazols handelt.

15

20

Im allgemeinen ist das Lichtabsorptionsverhalten von Lichtschutzfiltersubstanzen sehr gut bekannt und dokumentiert, zumal in den meisten Industrieländern Positivlisten für den Einsatz solcher Substanzen existieren, welche recht strenge Maßstäbe an die Dokumentation anlegen. Je nachdem, in welchem Bereich des UV-Lichtes absorbiert wird, unterscheidet man UV-B-Filter, UV-A-Filter und Breitbandfilter (welche über den gesamten Bereich des UV-A und UV-B eine Filterwirkung zeigen). Durch entsprechende Auswahl des UV-Filters und seiner Konzentration im Sonnenschutzmittel hat man die Möglichkeit, den Grad der Abschirmung des UV-Lichtes zu beeinflussen. Für die Dosierung der Substanzen in den fertigen Formulierungen können die Extinktionswerte allerdings allenfalls eine Orientierungshilfe bieten, denn durch Wechselwirkungen mit Inhaltsstoffen der Formulierung oder der Haut selbst können Unwägbarkeiten auftreten. Ferner ist in der Regel schwierig vorab abzuschätzen, wie gleichmäßig und in welcher Schichtdicke die Filtersubstanz in und auf der Hornschicht der Haut verteilt ist.

30

35

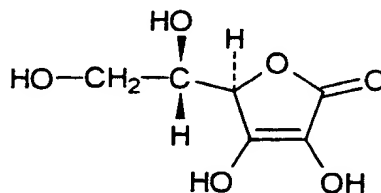
Eine wirksame Prophylaxe des Sonnenbrandes wurde bisher also lediglich durch den Einsatz klassischer UV-Filter oder UV-Blocker gelöst. Eine wirksame Linderung bereits manifesten Sonnenbrandes war bisher schwierig.

5

Es galt also, den Übelständen des Standes der Technik Abhilfe zu schaffen.

Die Verwendung der Ascorbinsäure in Kosmetika und Dermatika ist an sich bekannt. L-Ascorbinsäure {(R)-5-[(S)-1,2-Dihydroxyethyl]-3,4-dihydroxy-5-H-furan-2-on, Vitamin C} zeichnet sich durch die Strukturformel

10



aus. Sie ist leicht löslich in Wasser, gut löslich in Alkohol, unlöslich in Ether, Petrolether, Chloroform, Benzol sowie in Fetten u. fetten Ölen. Ascorbinsäure ist ein Endiol und wirkt als Redukton stark reduzierend. Ascorbinsäure ist wärmeempfindlich und wird insbesondere in Gegenwart von Schwermetallspuren sowie in alkalischem Milieu durch Licht und Luftsauerstoff zersetzt, in reinem, trockenem Zustand ist sie dagegen relativ beständig gegen Licht, Luft und Wärme.

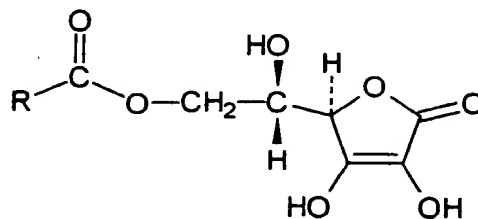
15

In kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen werden anstatt der Ascorbinsäure oftmals Ascorbylverbindungen, bevorzugt Ascorbylester von Fettsäuren, besonders bevorzugt Ascorbylpalmitat eingesetzt, da die Empfindlichkeit dieser Verbindungen auf oxidativen Einfluß gegenüber der Ascorbinsäure stark herabgesetzt ist und diese Verbindungen zumeist besser öllöslich sind, was galenische Vorteile bieten kann.

20

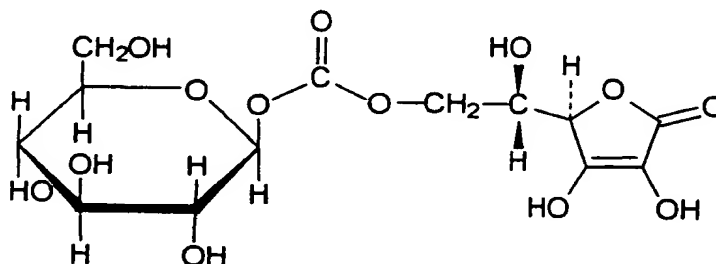
Ascorbylverbindungen im engeren Sinne sind insbesondere die Ascorbylester der allgemeinen Struktur

25



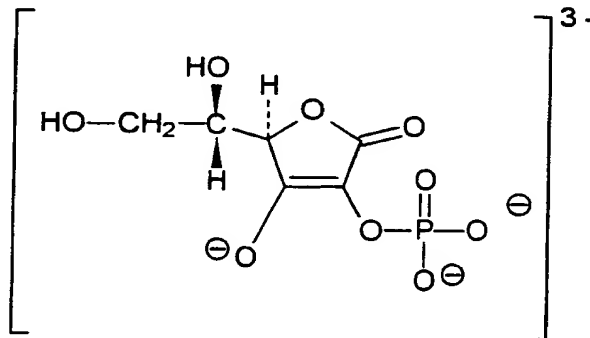
wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkylrest mit bis zu 25 Kohlenstoffatomen darstellen kann.

Auch Ascorbylglycoside sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, insbesondere die Ascorbylglucoside, insbesondere das Ascorbyl-2-glucosid, welches durch die Struktur



wiedergegeben wird.

Ascorbylverbindungen im engeren Sinne sind ferner die Ascorbylphosphate, insbesondere vorteilhaft die Ascorbyl-2-Phosphate der Ascorbinsäure bzw. deren Alkali-, Erdalkali-, Zinksalze oder gemischte Salze solcher Kationen.



Vorstehend dargestellt ist ein dreifach deprotoniertes Ascorbylphosphation, wiewohl auch andere Deprotonierungsstufen im Sinne der vorliegenden Erfindung vorteilhaft sind.

Bevorzugt sind die Natrium-, Magnesium- und Zinksalze, beispielsweise das Natrium-ascorbylphosphat.

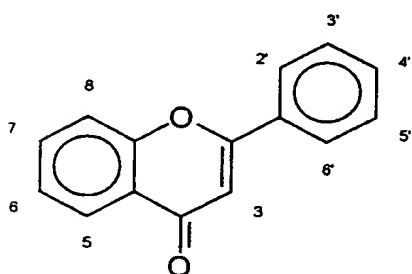
Die Verwendung von Flavonen bzw. Flavonoiden in der Kosmetik bzw. Dermatologie ist an sich bekannt. So beschreibt die DE-OS 44 44 238 Kombinationen von Zimtsäurederivaten und Flavonglycosiden, beispielsweise  $\alpha$ -Glycosylrutin als Antioxidantien und als Wirkstoffe gegen andere Indikationen.



Es war indes überraschend und für den Fachmann nicht vorauszusehen, daß die Verwendung von Ascorbinsäure und einem oder mehreren Flavonderivaten und/oder Flavanonderivaten, insbesondere Flavonoiden zur Herstellung kosmetischer oder dermatologischer Zubereitung zur Prophylaxe oder Linderung des Sonnenbrandes den Nach-  
 5 teilen des Standes der Technik abhelfen würde.

Flavon und seine Derivate (oft auch kollektiv „Flavone“ genannt) sind durch folgende Grundstruktur gekennzeichnet (Substitutionspositionen angegeben):

10

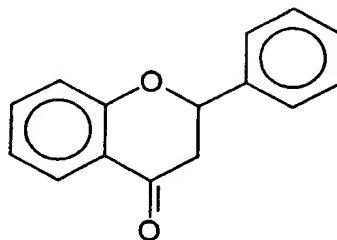


Einige der wichtigeren Flavone, welche auch in der belebten Natur aufzufinden sind, sind in der nachstehenden Tabelle aufgeführt:

	OH-Substitutionspositionen							
	3	5	7	8	2'	3'	4'	5'
Flavon	-	-	-	-	-	-	-	-
Flavonol	+	-	-	-	-	-	-	-
Chrysin	-	+	+	-	-	-	-	-
Galangin	+	+	+	-	-	-	-	-
Apigenin	-	+	+	-	-	-	+	-
Fisetin	+	-	+	-	-	+	+	-
Luteolin	-	+	+	-	-	+	+	-
Kämpferol	+	+	+	-	-	-	+	-
Quercetin	+	+	+	-	-	+	+	-
Morin	+	+	+	-	+	-	+	-
Robinetin	+	-	+	-	-	+	+	+
Gossypetin	+	+	+	+	-	+	+	-
Myricetin	+	+	+	-	-	+	+	+

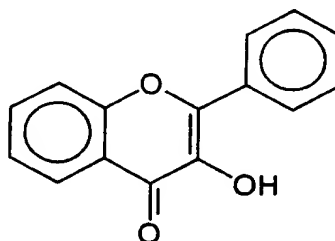
In der Natur kommen Flavone in der Regel in glycosidierter Form vor.

Flavonoide sind Glycoside der Flavone, der Flavanone, deren Grundgerüst durch die folgende Struktur gekennzeichnet ist:

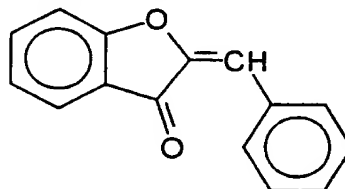


5

der 3-Hydroxyflavone (Flavonole), deren Grundgerüst durch die folgende Struktur gekennzeichnet ist:

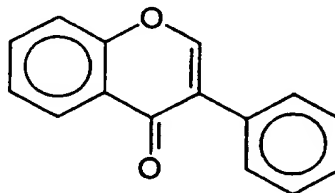


der Aurone, deren Grundgerüst durch die folgende Struktur gekennzeichnet ist:

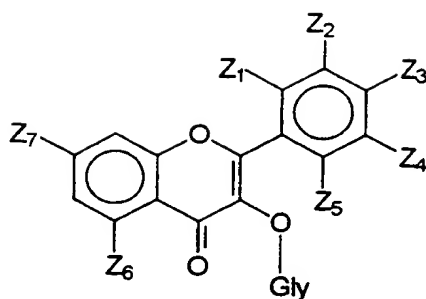


10

sowie der Isoflavone, deren Grundgerüst durch die folgende Struktur gekennzeichnet ist:

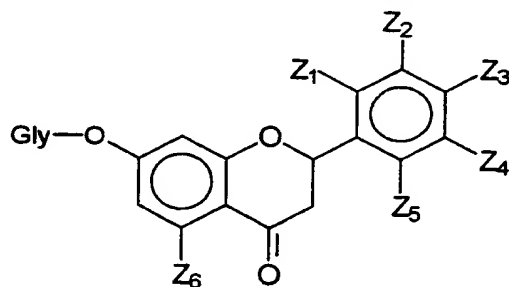


Erfindungsgemäß werden die Flavonoide bevorzugt gewählt gewählt aus der Gruppe der Substanzen der generischen Strukturformel



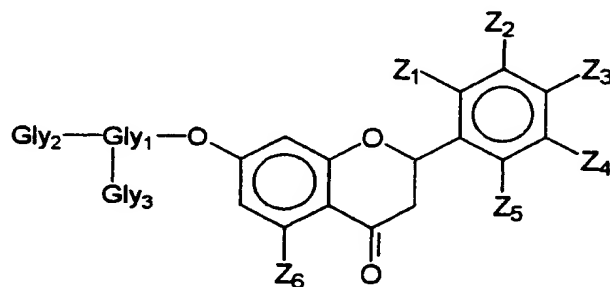
- wobei  $Z_1$  -  $Z_7$  unabhängig voneinander gewählt werden aus der Gruppe H, OH, Alkoxy- sowie Hydroxyalkoxy-, wobei die Alkoxy- bzw. Hydroxyalkoxygruppen verzweigt und unverzweigt sein und 1 - 18 C-Atome aufweisen können, und wobei Gly gewählt wird aus der Gruppe der Mono- und Oligoglycosidreste.
- 5

Erfindungsgemäß können die Flavonoide aber auch vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der Substanzen der generischen Strukturformel



- wobei  $Z_1$  -  $Z_6$  unabhängig voneinander gewählt werden aus der Gruppe H, OH, Alkoxy- sowie Hydroxyalkoxy-, wobei die Alkoxy- bzw. Hydroxyalkoxygruppen verzweigt und unverzweigt sein und 1 - 18 C-Atome aufweisen können, und wobei Gly gewählt wird aus der Gruppe der Mono- und Oligoglycosidreste.
- 10

- Bevorzugt können solche Strukturen gewählt werden aus der Gruppe der Substanzen der generischen Strukturformel
- 15

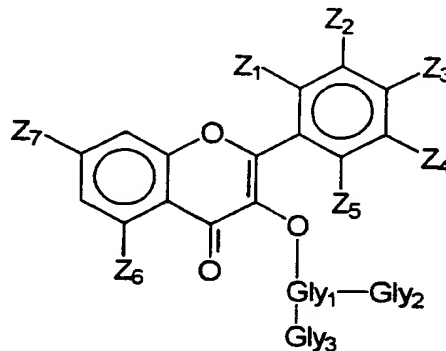


wobei Gly<sub>1</sub>, Gly<sub>2</sub> und Gly<sub>3</sub> unabhängig voneinander Monoglycosidreste oder darstellen. Gly<sub>2</sub> bzw. Gly<sub>3</sub> können auch einzeln oder gemeinsam Absättigungen durch Wasserstoffatome darstellen.

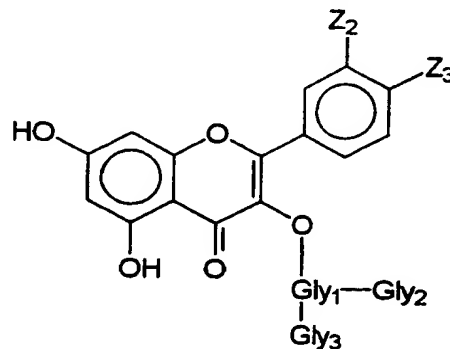
- 5 Bevorzugt werden Gly<sub>1</sub>, Gly<sub>2</sub> und Gly<sub>3</sub> unabhängig voneinander gewählt aus der Gruppe der Hexosylreste, insbesondere der Rhamnosylreste und Glucosylreste. Aber auch andere Hexosylreste, beispielsweise Allosyl, Altrosyl, Galactosyl, Gulosyl, Idosyl, Mannosyl und Talosyl sind gegebenenfalls vorteilhaft zu verwenden. Es kann auch erfindungsgemäß vorteilhaft sein, Pentosylreste zu verwenden.

10

Vorteilhaft werden Z<sub>1</sub> - Z<sub>5</sub> unabhängig voneinander gewählt aus der Gruppe H, OH, Methoxy-, Ethoxy- sowie 2-Hydroxyethoxy-, und die Flavonglycoside haben die Struktur



- 15 Besonders vorteilhaft werden die erfindungsgemäßen Flavonglycoside aus der Gruppe, welche durch die folgende Struktur wiedergegeben werden:



wobei Gly<sub>1</sub>, Gly<sub>2</sub> und Gly<sub>3</sub> unabhängig voneinander Monoglycosidreste oder darstellen. Gly<sub>2</sub> bzw. Gly<sub>3</sub> können auch einzeln oder gemeinsam Absättigungen durch Wasserstoffatome darstellen.

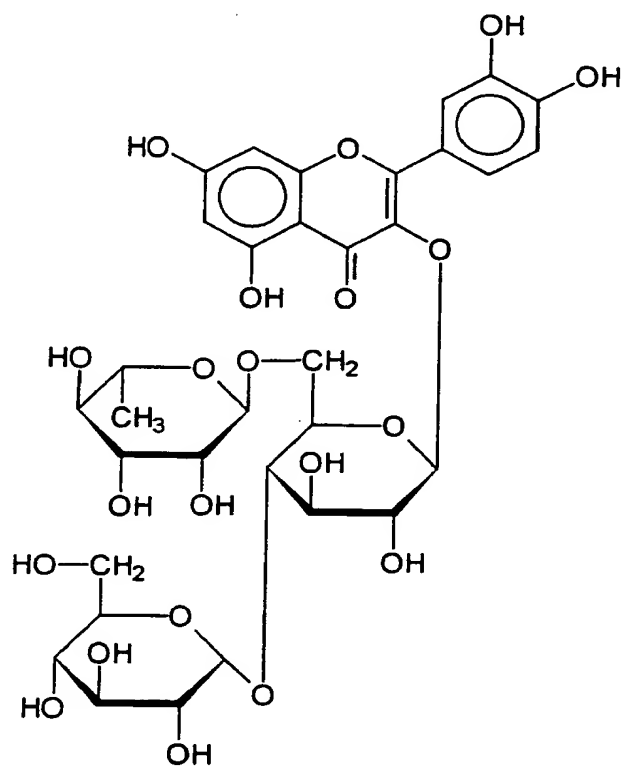
20

Bevorzugt werden Gly<sub>1</sub>, Gly<sub>2</sub> und Gly<sub>3</sub> unabhängig voneinander gewählt aus der Gruppe der Hexosylreste, insbesondere der Rhamnosylreste und Glucosylreste. Aber auch

andere Hexosylreste, beispielsweise Allosyl, Altrosyl, Galactosyl, Gulosyl, Idosyl, Mannosyl und Talosyl sind gegebenenfalls vorteilhaft zu verwenden. Es kann auch erfindungsgemäß vorteilhaft sein, Pentosylreste zu verwenden.

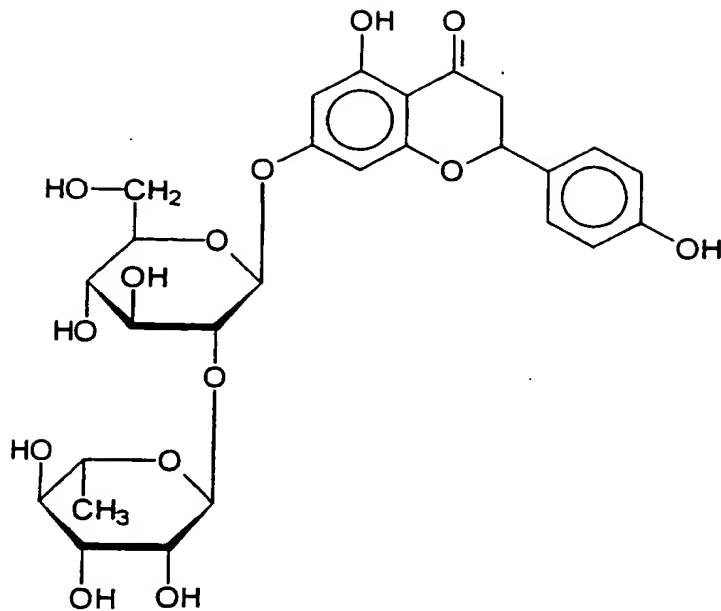
- 5 Besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung ist, das oder die Flavonglycoside zu wählen aus der Gruppe  $\alpha$ -Glucosylrutin,  $\alpha$ -Glucosylmyricitrin,  $\alpha$ -Glucosylisoquercitrin und  $\alpha$ -Glucosylquercitrin.

- 10 Ein erfindungsgemäß besonders vorteilhaftes Flavonoid ist  $\alpha$ -Glucosylrutin. Es zeichnet sich durch folgende Struktur aus:



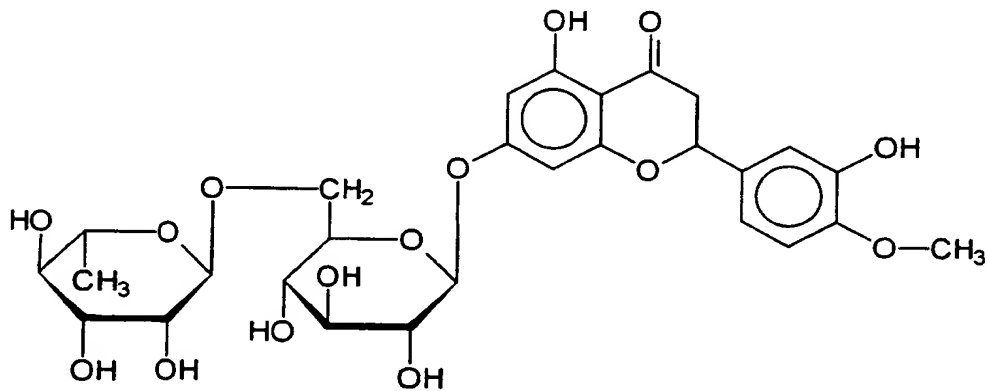
Ein weiteres erfindungsgemäß besonders vorteilhaftes Flavonoid ist Naringin (Aurantiin, Naringenin-7-rhamnoglucosid). Es zeichnet sich durch folgende Struktur aus:

10

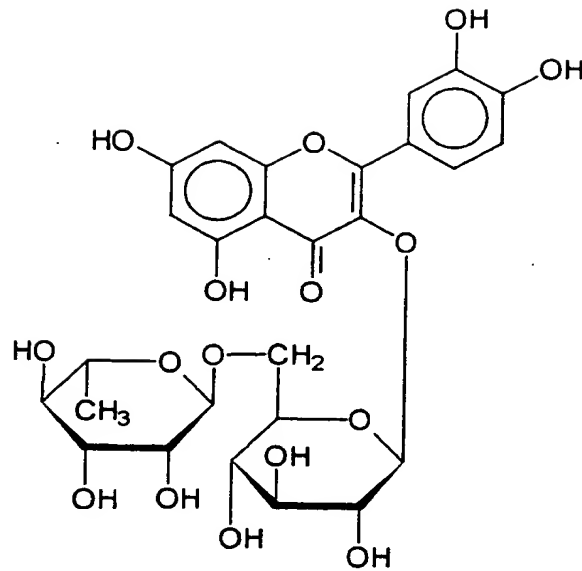


Ein weiteres erfindungsgemäß besonders vorteilhaftes Flavonoid ist Hesperidin (3',5,7-Trihydroxy-4'-methoxyflavanon-7-rutinosid, Hesperidosid, Hesperetin-7-O-rutinosid). Es zeichnet sich durch folgende Struktur aus:

5

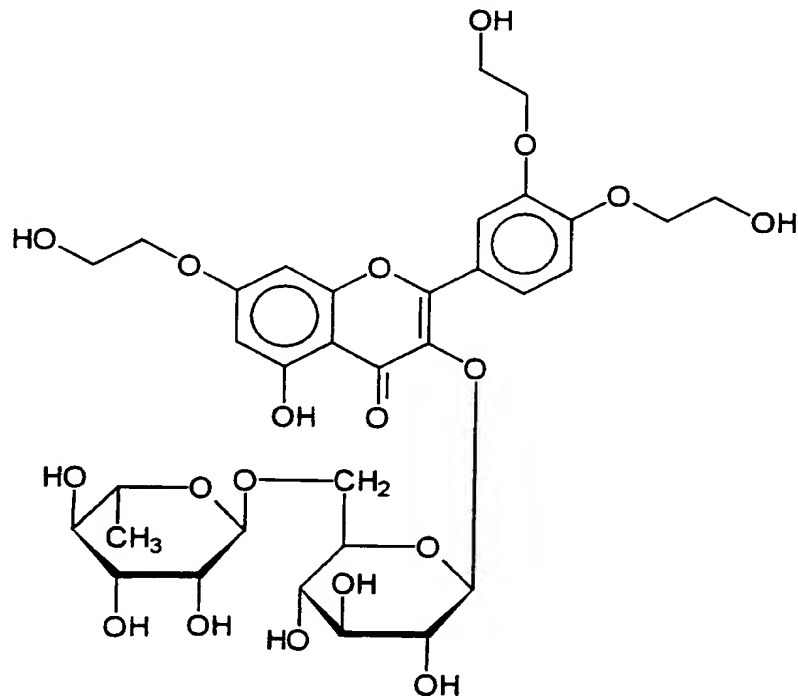


Ein weiteres erfindungsgemäß besonders vorteilhaftes Flavonoid ist Rutin (3,3',4',5,7-Pentahydroxyflavon-3-rutinosid, Quercetin-3-rutinosid, Sophorin, Birutan, Rutabion, Taurutin, Phytomelin, Melin). Es zeichnet sich durch folgende Struktur aus:

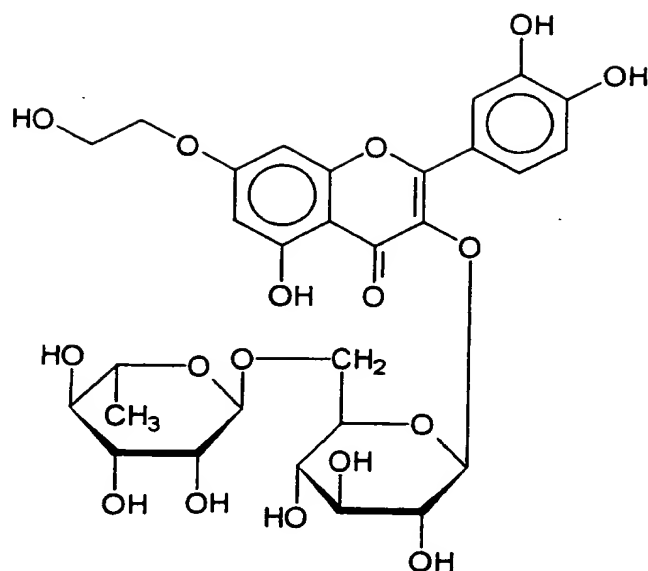


Ein weiteres erfindungsgemäß besonders vorteilhaftes Flavonoid ist Troxerutin (3,5-Dihydroxy-3',4',7-tris(2-hydroxyethoxy)-flavon-3-(6-O-(6-deoxy- $\alpha$ -L-mannopyranosyl)- $\beta$ -D-glucopyranosid)). Es zeichnet sich durch folgende Struktur aus:

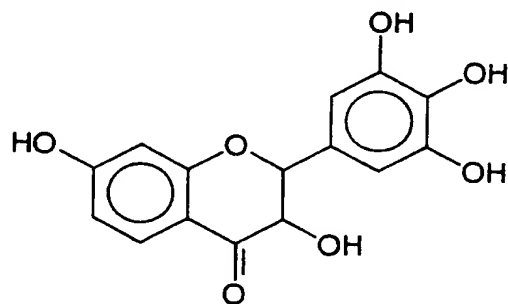
5



Ein weiteres erfindungsgemäß besonders vorteilhaftes Flavonoid ist Monoxerutin (3,3',4',5-Tetrahydroxy-7-(2-hydroxyethoxy)-flavon-3-(6-O-(6-deoxy- $\alpha$ -L-mannopyranosyl)- $\beta$ -D-glucopyranosid)). Es zeichnet sich durch folgende Struktur aus:

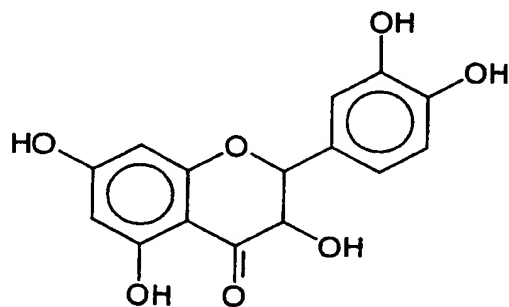


Ein weiteres erfindungsgemäß besonders vorteilhaftes Flavonoid ist Dihydrorobinetin (3,3',4',5',7-Pentahydroxyflavanon). Es zeichnet sich durch folgende Struktur aus:



5

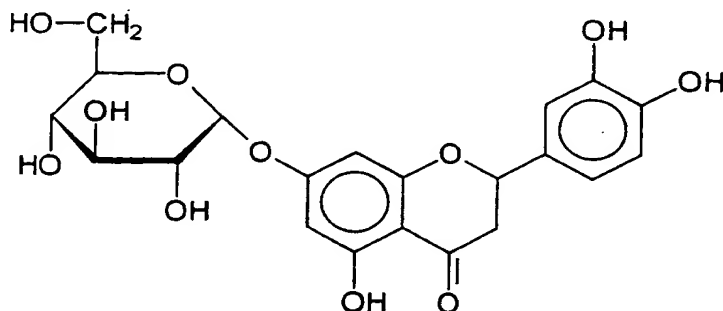
Ein weiteres erfindungsgemäß besonders vorteilhaftes Flavonoid ist Taxifolin (3,3',4',5',7-Pentahydroxyflavanon). Es zeichnet sich durch folgende Struktur aus:



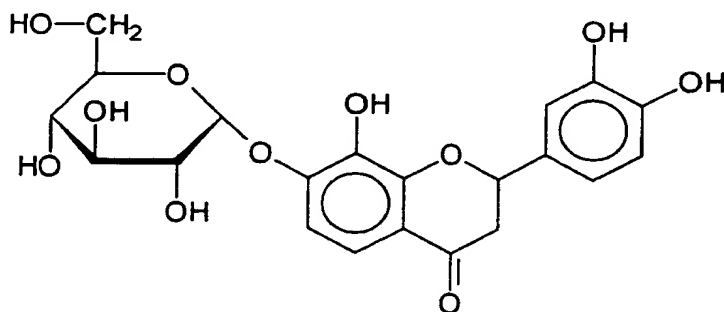
10



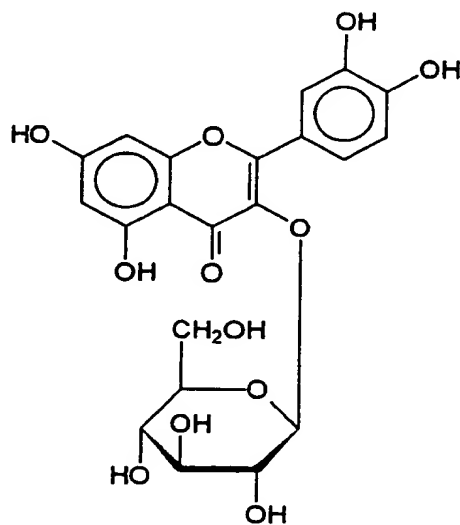
Ein weiteres erfindungsgemäß besonders vorteilhaftes Flavonoid ist Eriodictyol-7-glucosid (3',4',5,7-Tetrahydroxyflavanon-7-glucosid). Es zeichnet sich durch folgende Struktur aus:



- 5 Ein weiteres erfindungsgemäß besonders vorteilhaftes Flavonoid ist Flavanomarein (3',4',7,8-Tetrahydroxyflavanon-7-glucosid). Es zeichnet sich durch folgende Struktur aus:



- 10 Ein weiteres erfindungsgemäß besonders vorteilhaftes Flavonoid ist Isoquercitrin (3,3',4',5,7-Pentahydroxyflavanon-3-(β-D-Glucopyranosid)). Es zeichnet sich durch folgende Struktur aus:



Das oder die Flavonderivate und/oder Flavanonderivate, insbesondere Flavonoide sind erfindungsgemäß vorteilhaft in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen bevorzugt zu 0,001 Gew.-% bis 10 Gew.-%, bevorzugt zu 0,05 Gew.-% bis 5 Gew.-%, insbesondere bevorzugt zu 0,1 - 2,0 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, enthalten.

Die Ascorbylverbindung oder die Ascorbylverbindungen, insbesondere Vitamin C, ist bzw. sind erfindungsgemäß vorteilhaft in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen bevorzugt zu 0,001 Gew.-% bis 10 Gew.-%, bevorzugt zu 0,05 Gew.-% bis 5 Gew.-%, insbesondere bevorzugt zu 0,1 - 2,0 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, enthalten.

Die erfindungsgemäße Kombination aus mindestens einem Flavonderivat und/oder Flavanonderivat, insbesondere mindestens einem Flavonoid und mindestens einer Ascorbylverbindung, insbesondere Vitamin C, wird im Rahmen dieser Schrift auch kollektiv als „erfindungsgemäßer Wirkstoff“ oder „erfindungsgemäß verwendeter Wirkstoff“ oder „erfindungsgemäß verwendete Wirkstoffkombination“ bezeichnet bzw. mit sinnverwandten Bezeichnungen belegt.

Die Schrift JP-OS Hei-06-138,941 beschreibt zwar orale Zubereitungen mit einem Gehalt an wasserlöslichen Glycosiden, welche beispielsweise gewählt werden können aus der Gruppe  $\alpha$ -Glucosylrutin,  $\alpha$ -Glucosylmyricetin,  $\alpha$ -Glucosylisoquercitrin und  $\alpha$ -Glucosylquercitrin. Die Schrift JP-OS Hei-04-363,395 beschreibt ein Verfahren, die Zersetzung von Parfümbestandteilen zu verhindern, welche sich unter anderem durch einen Zusatz an  $\alpha$ -Glucosylrutin zu den entsprechenden Zubereitungen auszeichnet. Ferner beschreiben die Schriften EP-OS 586 303 und EP-OS 595 694 die Verwendung von Flavonoiden als Antioxidantien bzw. Lichtschutzsubstanzen in Kosmetika.

Kein Hinweis ist diesen Schriften aber zu entnehmen, welcher in die Richtung der vorliegenden Erfindung weisen könnte.

Es war vielmehr erstaunlich und für den Fachmann nicht vorhersehbar, daß Zubereitungen gemäß der erfindungsgemäßen Verwendung eine ausgezeichnete Prophylaxe des Sonnenbrandes gewährleisten würden, und das sogar, wenn auf die zusätzliche Gegenwart von UV-Filtersubstanzen oder UV-Blockern verzichtet wird. Ebenso erstaunlich

war, daß bei Befolgen der erfindungsgemäßen Lehre eine signifikante Linderung bereits manifesten Sonnenbrandes zu beobachten ist

5 Die erfindungsgemäßen kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen können wie üblich zusammengesetzt sein und zur Behandlung, der Pflege und der Reinigung der Haut dienen. Sie enthalten bevorzugt 0,001 Gew.-% bis 10 Gew.-%, bevorzugt 0,05 Gew.-% bis 5 Gew.-%, insbesondere 0,1 - 2,0 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, an erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffkombinationen.

10 Es ist erfindungsgemäß bevorzugt, den erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffkombinationen bzw. kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen, solche Wirkstoffkombinationen enthaltend Komplexbildner zuzufügen.

15 Komplexbildner sind an sich bekannte Hilfsstoffe der Kosmetologie bzw. der medizinischen Galenik. Durch die Komplexierung von störenden Metallen wie Mn, Fe, Cu und anderer können beispielsweise unerwünschte chemische Reaktionen in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen verhindert werden.

20 Komplexbildner, insbesondere Chelatoren, bilden mit Metallatomen Komplexe, welche bei Vorliegen eines oder mehrerer mehrbasiger Komplexbildner, also Chelatoren, Metallacyclen darstellen. Chelate stellen Verbindungen dar, in denen ein einzelner Ligand mehr als eine Koordinationsstelle an einem Zentralatom besetzt. In diesem Falle werden also normalerweise gestreckte Verbindungen durch Komplexbildung über ein Metallatom od. -ion zu Ringen geschlossen. Die Zahl der gebundenen Liganden hängt von der  
25 Koordinationszahl des zentralen Metalls ab. Voraussetzung für die Chelatbildung ist, daß die mit dem Metall reagierende Verbindung zwei oder mehr Atomgruppierungen enthält, die als Elektronendonatoren wirken.

30 Der oder die Komplexbildner können vorteilhaft aus der Gruppe der üblichen Verbindungen gewählt werden, wobei bevorzugt mindestens eine Substanz aus der Gruppe bestehend aus Weinsäure und deren Anionen, Citronensäure und deren Anionen, Aminopolycarbonsäuren und deren Anionen (wie beispielsweise Ethylendiamintetraessigsäure (EDTA) und deren Anionen, Nitrilotriessigsäure (NTA) und deren Anionen, Hydroxyethylendiaminotriessigsäure (HOEDTA) und deren Anionen, Diethylenaminopentaessigsäure (DPTA) und deren Anionen, trans-1,2-Diaminocyclohexantetraessigsäure (CDTA) und deren Anionen).

35

Der oder die Komplexbildner sind erfindungsgemäß vorteilhaft in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen bevorzugt zu 0,01 Gew.-% bis 10 Gew.-%, bevorzugt zu 0,05 Gew.-% bis 5 Gew.-%, insbesondere bevorzugt zu 0,1 - 2,0 Gew.-%, bezogen auf  
5 das Gesamtgewicht der Zubereitungen, enthalten.

Zur Anwendung werden die kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen erfindungsgemäß in der für Kosmetika üblichen Weise auf die Haut in ausreichender Menge aufgebracht.

10

Erfindungsgemäße kosmetische und dermatologische Zubereitungen können in verschiedenen Formen vorliegen. So können sie z.B. eine Lösung, eine wasserfreie Zubereitung, eine Emulsion oder Mikroemulsion vom Typ Wasser-in-Öl (W/O) oder vom Typ Öl-in-Wasser (O/W), eine multiple Emulsionen, beispielsweise vom Typ Wasser-in-Öl-in-Wasser (W/O/W), ein Gel, einen festen Stift, eine Salbe oder auch ein Aerosol darstellen. Es ist auch vorteilhaft, Isoquercitrin in verkapselter Form darzureichen, z.B. in Kollagenmatrices und anderen üblichen Verkapselungsmaterialien, z.B. als Celluloseverkapselungen, in Gelatine, Wachsmatrices oder liposomal verkapselt. Insbesondere Wachsmatrices wie sie in der DE-OS 43 08 282 beschrieben werden, haben sich als  
15  
20 günstig herausgestellt.

Die erfindungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen können kosmetische Hilfsstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen verwendet werden, z.B. Konservierungsmittel, Bakterizide, Parfüme, Substanzen zum Verhindern des Schäumens, Farbstoffe, Pigmente, die eine färbende Wirkung haben, Verdickungsmittel, oberflächenaktive Substanzen, Emulgatoren, weichmachende, anfeuchtende und/oder feuchthaltende Substanzen, Fette, Öle, Wachse oder andere übliche Bestandteile einer kosmetischen oder dermatologischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organische Lösemittel oder Silikon-  
25  
30 derivate.

Insbesondere können erfindungsgemäß verwendete Wirkstoffkombinationen auch mit anderen Antioxidantien und/oder Radikalfängern kombiniert werden.

35 Vorteilhaft werden solche Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z.B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z.B.

Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z.B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z.B.  $\alpha$ -Carotin,  $\beta$ -Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Chlorogensäure und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z.B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z.B. 5 Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-,  $\gamma$ -Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z.B. Buthioninsulfoximine, Homocysteinsulfoximin, 10 Buthioninsulfone, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z.B. pmol bis  $\mu$ mol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z.B.  $\alpha$ -Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin),  $\alpha$ -Hydroxysäuren (z.B. Citronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren 15 Derivate (z.B.  $\gamma$ -Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Ubichinon und Ubichinol und deren Derivate, Tocopherole und Derivate (z.B. Vitamin-E-acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin-A-palmitat) sowie Koniferylbenzoat des Benzoeharzes, Rutinsäure und deren Derivate, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajaretsäure, Trihydroxybutyrophenon, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Sesamol, Sesamolin, Zink und dessen 20 Derivate (z.B. ZnO, ZnSO<sub>4</sub>) Selen und dessen Derivate (z.B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z.B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

25

Die Menge der vorgenannten Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 - 20 Gew.-%, insbesondere 0,1 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

30

Sofern Vitamin E und/oder dessen Derivate das oder die zusätzlichen Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

35

Sofern Vitamin A, bzw. Vitamin-A-Derivate, bzw. Carotine bzw. deren Derivate das oder die zusätzlichen Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentration n

aus dem Bereich von 0,001 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

- 5 Erfindungsgemäße Emulsionen sind vorteilhaft und enthalten z.B. die genannten Fette, Öle, Wachse und anderen Fettkörper, sowie Wasser und einen Emulgator, wie er üblicherweise für einen solchen Typ der Formulierung verwendet wird.

Die Lipidphase kann vorteilhaft gewählt werden aus folgender Substanzgruppe:

- Mineralöle, Mineralwachse
  - 10 - Öle, wie Triglyceride der Caprin- oder der Caprylsäure, ferner natürliche Öle wie z.B. Rizinusöl;
  - Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z.B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettalkoholen mit Alkansäuren niedriger
  - 15 C-Zahl oder mit Fettsäuren;
  - Alkylbenzoate;
  - Silikonöle wie Dimethylpolysiloxane, Diethylpolysiloxane, Diphenylpolysiloxane sowie Mischformen daraus.
- 20 Die Ölphase der Emulsionen, Oleogele bzw. Hydrodispersionen oder Lipodispersionen im Sinne der vorliegenden Erfindung wird vorteilhaft gewählt aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-
- 25 Atomen, aus der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen. Solche Esteröle können dann vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Isopropylstearat, Isopropyloleat, n-Butylstearat, n-Hexyllaurat, n-Decyloleat, Isooctylstearat, Isononylstearat, Isononyliso-
- 30 nonanoat, 2-Ethylhexylpalmitat, 2-Ethylhexyllaurat, 2-Hexyldecylstearat, 2-Octyldodecylpalmitat, Oleyloleat, Oleylerucat, Erucyloleat, Erucylerucat sowie synthetische, halbsynthetische und natürliche Gemische solcher Ester, z.B. Jojobaöl.

Ferner kann die Ölphase vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Kohlenwasserstoffe und -wachse, der Silikonöle, der Dialkylether, der Gruppe der gesättigten oder ungesättigten, verzweigten oder unverzweigten Alkohole, sowie der Fettsäuretriglyceride, namentlich der Triglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12 - 18 C-Atomen. Die Fettsäuretriglyceride können beispielsweise vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der synthetischen, halbsynthetischen und natürlichen Öle, z.B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaöl, Erdnußöl, Rapsöl, Mandelöl, Palmöl, Kokosöl, Palmkernöl und dergleichen mehr.

10

Auch beliebige Abmischungen solcher Öl- und Wachskomponenten sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung einzusetzen. Es kann auch gegebenenfalls vorteilhaft sein, Wachse, beispielsweise Cetylpalmitat, als alleinige Lipidkomponente der Ölphase einzusetzen.

15

Vorteilhaft wird die Ölphase gewählt aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisononanoat, Isoeicosan, 2-Ethylhexylcocoat, C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat, Capryl-Caprinsäure-triglycerid, Dicaprylylether.

20

Besonders vorteilhaft sind Mischungen aus C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat und 2-Ethylhexylisostearat, Mischungen aus C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat und Isotridecylisononanoat sowie Mischungen aus C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat, 2-Ethylhexylisostearat und Isotridecylisononanoat.

25

Von den Kohlenwasserstoffen sind Paraffinöl, Squalan und Squalen vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden.

30

Vorteilhaft kann die Ölphase ferner einen Gehalt an cyclischen oder linearen Silikonölen aufweisen oder vollständig aus solchen Ölen bestehen, wobei allerdings bevorzugt wird, außer dem Silikonöl oder den Silikonölen einen zusätzlichen Gehalt an anderen Ölphasenkomponenten zu verwenden.

Vorteilhaft wird Cyclomethicon (Octamethylcyclotetrasiloxan) als erfindungsgemäß zu verwendendes Silikonöl eingesetzt. Aber auch andere Silikonöle sind vorteilhaft im Sinne

der vorliegenden Erfindung zu verwenden, beispielsweise Hexamethylcyclotrisiloxan, Polydimethylsiloxan, Poly(methylphenylsiloxan).

5 Besonders vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisooctanoat, aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

Die wäßrige Phase der erfindungsgemäßen Zubereitungen enthält gegebenenfalls vorteilhaft Alkohole, Diöle oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte, ferner Alkohole niedriger C-Zahl, z.B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin sowie insbesondere ein oder mehrere Verdickungsmittel, welches oder welche vorteilhaft gewählt werden können aus der Gruppe Siliciumdioxid, Aluminiumsilikate, Polysaccharide bzw. deren Derivate, z.B. Hyaluronsäure, Xanthangummi, Hydroxypropylmethylcellulose, besonders vorteilhaft aus der Gruppe der Polyacrylate, bevorzugt ein Polyacrylat aus der Gruppe der sogenannten Carbopole, beispielsweise Carbopole der Typen 980, 981, 1382, 2984, 5984, jeweils einzeln oder in Kombination.

20 Insbesondere werden Gemische der vorstehend genannten Lösemittel verwendet. Bei alkoholischen Lösemitteln kann Wasser ein weiterer Bestandteil sein.

Erfindungsgemäße Emulsionen sind vorteilhaft und enthalten z.B. die genannten Fette, Öle, Wachse und anderen Fettkörper, sowie Wasser und einen Emulgator, wie er üblicherweise für einen solchen Typ der Formulierung verwendet wird.

Gele gemäß der Erfindung enthalten üblicherweise Alkohole niedriger C-Zahl, z.B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin und Wasser bzw. ein vorstehend genanntes Öl in Gegenwart eines Verdickungsmittels, das bei ölig-alkoholischen Gelen vorzugsweise Siliciumdioxid oder ein Aluminiumsilikat, bei wäßrig-alkoholischen oder alkoholischen Gelen vorzugsweise ein Polyacrylat ist.

Als Treibmittel für erfindungsgemäße, aus Aerosolbehältern versprühbare Zubereitungen sind die üblichen bekannten leichtflüchtigen, verflüssigten Treibmittel, beispielsweise



Kohlenwasserstoffe (Propan, Butan, Isobutan) geeignet, die allein oder in Mischung miteinander eingesetzt werden können. Auch Druckluft ist vorteilhaft zu verwenden.

Vorteilhaft können erfindungsgemäße Zubereitungen außerdem Substanzen enthalten, die UV-Strahlung im UVB-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z.B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 10 Gew.-%, insbesondere 1,0 bis 6,0 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, um kosmetische Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die das Haar bzw. die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel fürs Haar oder die Haut dienen.

Enthalten die erfindungsgemäßen Zubereitungen UVB-Filtersubstanzen, können diese öllöslich oder wasserlöslich sein. Erfindungsgemäß vorteilhafte öllösliche UVB-Filter sind z.B.:

- 15 - 3-Benzylidencampher-Derivate, vorzugsweise 3-(4-Methylbenzyliden)campher, 3-Benzylidencampher;
- 4-Aminobenzoësäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoësäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoësäureamylester;
- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;
- 20 - Ester der Salicylsäure, vorzugsweise Salicylsäure(2-ethylhexyl)ester, Salicylsäure(4-isopropylbenzyl)ester, Salicylsäurehomomenthylester,
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon;
- 25 - Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmalonsäuredi(2-ethylhexyl)ester, - 2,4,6-Triänilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy) -1,3,5-triazin.

Vorteilhafte wasserlösliche UVB-Filter sind z.B.:

- 30 - Salze der 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure wie ihr Natrium-, Kalium- oder ihr Triethanolammonium-Salz, sowie die Sulfonsäure selbst;
- Sulfonsäure-Derivate von Benzophenonen, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon-5-sulfonsäure und ihre Salze;
- 35 - Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencamphers, wie z.B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure, 2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornylidenmethyl)sulfonsäure und

ihre Salze sowie das 1,4-di(2-oxo-10-Sulfo-3-bornylidenmethyl)-Benzol und dessen Salze (die entsprechenden 10-Sulfato-Verbindungen, beispielsweise das entsprechende Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salz), auch als Benzol-1,4-di(2-oxo-3-bornylidenmethyl-10-Sulfonsäure bezeichnet

5

Die Liste der genannten UVB-Filter, die in Kombination mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen verwendet werden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

- 10 Gegenstand der Erfindung ist auch die Verwendung einer Kombination der erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffkombinationen mit mindestens einem UVB-Filter als Antioxidans bzw. die Verwendung einer Kombination der erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffkombinationen mit mindestens einem UVB-Filter als Antioxidans in einer kosmetischen oder dermatologischen Zubereitung.

15

Es kann auch von Vorteil sein, die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffkombinationen mit UVA-Filtern zu kombinieren, die bisher üblicherweise in kosmetischen Zubereitungen enthalten sind. Bei diesen Substanzen handelt es sich vorzugsweise um Derivate des Dibenzoylmethans, insbesondere um 1-(4'-tert-Butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propan-1,3-dion und um 1-Phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)propan-1,3-dion. Auch diese Kombinationen bzw. Zubereitungen, die diese Kombinationen enthalten, sind Gegenstand der Erfindung. Es können die für die UVB-Kombination verwendeten Mengen eingesetzt werden.

20

- 25 Kosmetische und dermatologische Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffkombinationen können auch anorganische Pigmente enthalten, die üblicherweise in der Kosmetik zum Schutze der Haut vor UV-Strahlen verwendet werden. Dabei handelt es sich um Oxide des Titans, Zinks, Zirkoniums, Siliciums, Mangans, Cers und Mischungen davon, sowie Abwandlungen, bei denen die Oxide die aktiven Agentien sind. Besonders bevorzugt handelt es sich um Pigmente auf der Basis von Titandioxid.

30

- Auch diese Kombinationen von UVA-Filter und Pigment bzw. Zubereitungen, die diese Kombination enthalten, sind Gegenstand der Erfindung. Es können die für die vorstehenden Kombinationen genannten Mengen verwendet werden.

35

Unter Elektrolyten im Sinne der vorliegenden Erfindung sind wasserlösliche Alkali-, Ammonium-, Erdalkali- (unter Einbeziehung des Magnesiums) und Zinksalze anorganischer Anionen und beliebige Gemische aus solchen Salzen zu verstehen, wobei gewährleistet sein muß, daß sich diese Salze durch pharmazeutische oder kosmetische Unbedenklichkeit auszeichnen.

Die erfindungsgemäßen Anionen werden bevorzugt gewählt aus der Gruppe der Chloride, der Sulfate und Hydrogensulfate, der Phosphate, Hydrogenphosphate und der linearen und cyclischen Oligophosphate sowie der Carbonate und Hydrogencarbonate.

Diese kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen können auch Aerosole mit den üblicherweise dafür verwendeten Hilfsmitteln darstellen.

Vorzugsweise beträgt die Menge an erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffkombinationen in diesen Zubereitungen 0,01 - 10 Gew.-%, bevorzugt 0,05 - 5 Gew.-%, insbesondere 0,1 - 2,0 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen, ohne sie einzuschränken. Alle Mengenangaben, Anteile und Prozentanteile sind, soweit nicht anders angegeben, auf das Gewicht und die Gesamtmenge bzw. auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen bezogen.

**Beispiel 1**

## O/W Crème

	Gew.-%
Glycerylstearat	5,00
Cetylalkohol	5,00
Isopropylpalmitat	7,00
Cyclomethicon	5,00
Ascorbinsäure	3,00
$\alpha$ -Glucosylrutin	0,30
NaOH 45 %-ig	1,00
Butylenglycol	3,00
Na <sub>2</sub> H <sub>2</sub> EDTA	0,20
Farbstoffe, Parfum,	q.s.
Konservierungsmittel	
Wasser	ad 100,00

**Beispiel 2**

5

## O/W Lotion

	Gew.-%
Steareth-20	3,00
Cetylalkohol	3,00
Cyclomethicon	6,00
Carbomer	0,60
Na <sub>2</sub> H <sub>2</sub> EDTA	0,20
Butylenglycol	3,00
NaOH 45 %-ig	0,40
Ascorbinsäure	0,50
$\alpha$ -Glucosylrutin	0,10
Farbstoffe, Parfum,	q.s.
Konservierungsmittel	
Wasser	ad 100,00

**Beispiel 3**

W/O Crème

	Gew.-%
Polyglyceryl-2-dipolyhydroxystearat	5,00
Caprylic/Capric Triglyceride	15,00
Butylenglycol	3,00
Na <sub>2</sub> H <sub>2</sub> EDTA	0,20
MgSO <sub>4</sub>	0,70
NaOH 45 %-ig	0,32
Ascorbinsäure	1,00
$\alpha$ -Glucosylrutin	0,20
Farbstoffe, Parfum,	q.s.
Konservierungsmittel	
Wasser	ad 100,00

5 **Beispiel 4**

O/W-Gel

	Gew.-%
Xanthangummi	2,00
Butylenglycol	3,00
Na <sub>2</sub> H <sub>2</sub> EDTA	0,20
NaOH 45 %-ig	0,32
Ascorbinsäure	1,00
$\alpha$ -Glucosylrutin	0,20
Farbstoffe, Parfum,	q.s.
Konservierungsmittel	
Wasser	ad 100,00

**Beispiel 5**

O/W-Haarkur

	Gew.-%
Bis-Diglycerylpolyacyladipat-2	3,00
Behenylalkohol	4,00
Butylenglycol	3,00
Cetrimoniumchlorid	5,00
Citronensäure	0,50
Na <sub>2</sub> H <sub>2</sub> EDTA	0,20
NaOH 45 %-ig	0,16
Ascorbinsäure	0,50
$\alpha$ -Glucosylrutin	0,10
Farbstoffe, Parfum,	q.s.
Konservierungsmittel	
Wasser	ad 100,00

**Beispi 16****Sonnenschutzemulsion**

	Gew.-%
Cyclomethicon	2,00
Cetylstearylalkohol +PEG 40-hydriertes	2,50
Rizinusöl +Natrium Cetylstearylsulfat	
Glyceryllanolat	1,00
Caprylsäure-/Caprinsäure Triglycerid	0,10
Laurylmethicon Copolyol	2,00
Octylstearat	3,00
Rizinusöl	4,00
Glycerin	3,00
Acrylamid/Natriumacrylat Copolymer	0,30
Hydroxypropylmethylcellulose	0,30
Octylmethoxycinnamat	5,00
Butyl-methoxy-dibenzoylmethan	0,75
$\alpha$ -Glucosylrutin	0,50
Ascorbyl-2-glucosid	1,00
Epigallocatechingallat	0,20
$\alpha$ -Tocopherylacetat	1,00
Na <sub>3</sub> HEDTA	1,50
Konservierungsmittel, Farbstoffe, Parfüm	q.s.
Wasser	ad 100,00

**Beispi 17**

O/W Lotion

	Gew.-%
Paraffinöl (DAB 9)	8,00
Isopropylpalmitat	3,00
Petrolatum	4,00,
Cetylstearylalkohol	2,00
PEG 40 Rizinusöl	0,50
Natriumcetylstearylsulfat	0,50
Natrium Carbomer	0,40
$\alpha$ -Glucosylrutin	0,50
Glycerin	3,00
Ascorbylpalmitat	1,00
Octylmethoxycinnamat	5,00
Butylmethoxydibenzoylmethan	1,00
Konservierungsmittel, Farbstoffe, Parfüm	q.s.
Epigallocatechingallat	0,05
Wasser	ad 100,00

**Beispiel 8**

5

O/W Creme

	Gew.-%
Paraffinöl (DAB 9)	7,00
Avocadoöl	4,00
Glycerylmonostearat	2,00
$\alpha$ -Glucosylrutin	0,80
Mg-Ascorbylphosphat	0,50
Natriumlactat	3,00
Glycerin	3,00
Konservierungsmittel, Farbstoffe, Parfüm	q.s.
Epigallat chingallat	3,00
Wasser	ad 100,00



Pat ntsprüche

1. Verwendung von Ascorbinsäure und/oder Ascorbylverbindungen und einem oder mehreren Flavonderivaten und/oder Flavanonderivaten, insbesondere Flavonoiden zur Herstellung kosmetischer oder dermatologischer Zubereitung zur Prophylaxe oder Linderung des Sonnenbrandes.  
5
2. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß der oder die Wirkstoffe, gewählt aus der Gruppe der Flavone, Flavanone und Flavonoide in einem wirksamen Gehalt in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen vorliegt.  
10
3. Verwendung nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß daß der oder die Wirkstoffe, gewählt aus der Gruppe der Flavone, Flavanone und Flavonoide in kosmetischen oder topischen dermatologischen Zubereitungen in Konzentrationen von 0,01 - 10 Gew.-%, bevorzugt 0,05 - 5 Gew.-%, insbesondere 0,1 - 2,0 Gew.-% bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, vorliegt.  
15
4. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß der oder die Wirkstoffe, gewählt aus der Gruppe der Ascorbinsäure und der Ascorbylverbindungen in einem wirksamen Gehalt in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen vorliegt.  
20
5. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die Ascorbylverbindungen gewählt werden aus der Gruppe Ascorbylpalmitat, Natriumascorbylphosphat, Magnesiumascorbylphosphat, Zinkascorbylphosphat, Ascorbyl-2-glucosid.  
25
6. Verwendung nach Anspruch 4, dadurch gekennzeichnet, daß daß der oder die Wirkstoffe, gewählt aus der Gruppe der Ascorbinsäure und der Ascorbylverbindungen in kosmetischen oder topischen dermatologischen Zubereitungen in Konzentrationen von 0,001 - 10 Gew.-%, bevorzugt 0,05 - 5 Gew.-%, insbesondere 0,1 - 2,0 Gew.-% bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, vorliegt.  
30
7. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet daß als Wirkstoff, gewählt aus der Gruppe der Flavone, Flavanone und Flavonoide das  $\alpha$ -Glucosylrutin gewählt wird.

8. Verwendung nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß die kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zusätzlich einen oder mehrere Komplexbildner enthalten.

5

9. Verwendung nach Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, daß der oder die Komplexbildner gewählt wird oder werden aus der Gruppe bestehend aus Weinsäure und deren Anionen, Citronensäure und deren Anionen, Aminopolycarbonsäuren und deren Anionen (wie beispielsweise Ethylendiamintetraessigsäure und deren Anionen, Nitrilotriessigsäure und deren Anionen, Hydroxyethylendiaminotriessigsäure und deren Anionen, Diethylenaminopentaessigsäure und deren Anionen, trans-1,2-Diaminocyclohexantetraessigsäure und deren Anionen).

10

10. Verwendung nach Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, daß der oder die Komplexbildner sind in den kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen bevorzugt zu 0,01 Gew.-% bis 10 Gew.-%, bevorzugt zu 0,05 Gew.-% bis 5 Gew.-%, insbesondere bevorzugt zu 0,1 - 2,0 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, enthalten ist oder sind.

15

### A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
IPC 7      A61K7/42      A61P17/16      A61K7/48

**According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC**

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 A61K A61P

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

PAJ. EPO-Internal, CHEM ABS Data

### C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 5 882 658 A (SIMON PASCAL ET AL) 16 March 1999 (1999-03-16) column 1, line 42 - column 1, line 67; claims 1,12; examples 1,2	1,6
A	DE 42 43 363 A (KUEBLER ULRICH DR MED) 23 June 1994 (1994-06-23) claim 1	1
A	DE 42 27 806 A (FISCHER PHARMA LTD) 25 February 1993 (1993-02-25) page 2, line 47 - line 52; claims 1,4	1
A	DE 43 39 486 A (BACKHAUS ERWIN) 24 May 1995 (1995-05-24) column 1, line 50 - line 51; claim 1	1
	-/--	



Further documents are listed in the continuation of box C.



Patent family members are listed in annex.

\* Special categories of cited documents :

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*G\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

**22 September 2000**

Date of mailing of the international search report

29/09/2000

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

**Authorized officer**

**Voyiazoglou, D**

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Pat. International Application No

PCT/EP 00/04938

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	FR 2 666 226 A (THOREL JEAN NOEL) 6 March 1992 (1992-03-06) claims 1,2,4	1
A	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1999, no. 10, 31 August 1999 (1999-08-31) & JP 11 124341 A (RISUBURAN:KK), 11 May 1999 (1999-05-11) abstract	1
A	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 018, no. 061 (C-1160), 2 February 1994 (1994-02-02) & JP 05 279225 A (SUNTORY LTD), 26 October 1993 (1993-10-26) abstract	1
A	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1995, no. 09, 31 October 1995 (1995-10-31) & JP 07 157494 A (KAO CORP), 20 June 1995 (1995-06-20) abstract	1
A	WO 98 47534 A (KLINGE CO CHEM PHARM FAB ;STANISLAUS FRITZ (DE)) 29 October 1998 (1998-10-29) page 13, line 1 - line 15; claims 14,15	1
A	FR 2 723 316 A (THOREL JEAN NOEL) 9 February 1996 (1996-02-09) claims 1,2,7	1
A	US 5 843 411 A (SHAFFER BURT ET AL) 1 December 1998 (1998-12-01) column 5, line 15 - line 25; claims 1,19	1
A	WO 96 18379 A (BEIERSDORF AG) 20 June 1996 (1996-06-20) cited in the application claim 1	1
A	US 5 409 693 A (PERRICONE NICHOLAS V) 25 April 1995 (1995-04-25) claims 1,13	1
P,X	DE 198 07 774 A (BEIERSDORF AG) 26 August 1999 (1999-08-26) page 1, line 14 - line 25; claims 1,6	1,6
	-/-	

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Int'l Application No  
PCT/EP 00/04938

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, A	<p>PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1999, no. 13, 30 November 1999 (1999-11-30) &amp; JP 11 222412 A (SHISEIDO CO LTD; SOGO PHARMACEUT CO LTD), 17 August 1999 (1999-08-17) abstract</p>	1

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 00/04938

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 5882658	A	16-03-1999	FR 2736829 A CN 1147936 A DE 69600106 D DE 69600106 T EP 0754449 A ES 2112076 T JP 3004206 B JP 9030921 A	24-01-1997 23-04-1997 02-01-1998 26-03-1998 22-01-1997 16-03-1998 31-01-2000 04-02-1997
DE 4243363	A	23-06-1994	NONE	
DE 4227806	A	25-02-1993	IL 99291 A AU 654030 B AU 2122092 A CA 2076467 A CH 684739 A ES 2050074 A FR 2680466 A GB 2259014 A, B PT 100800 A, B	15-04-1997 20-10-1994 25-02-1993 24-02-1993 15-12-1994 01-05-1994 26-02-1993 03-03-1993 28-02-1994
DE 4339486	A	24-05-1995	NONE	
FR 2666226	A	06-03-1992	NONE	
JP 11124341	A	11-05-1999	NONE	
JP 05279225	A	26-10-1993	NONE	
JP 07157494	A	20-06-1995	NONE	
WO 9847534	A	29-10-1998	AU 2387997 A EP 0971743 A	13-11-1998 19-01-2000
FR 2723316	A	09-02-1996	NONE	
US 5843411	A	01-12-1998	NONE	
WO 9618379	A	20-06-1996	DE 4444238 A WO 9618380 A WO 9618381 A WO 9618382 A EP 0716847 A EP 0799020 A EP 0799022 A EP 0797427 A EP 0799023 A JP 8259421 A JP 10510522 T JP 10510523 T JP 10510802 T JP 10510803 T US 5952373 A	20-06-1996 20-06-1996 20-06-1996 20-06-1996 19-06-1996 08-10-1997 08-10-1997 01-10-1997 08-10-1997 08-10-1996 13-10-1998 13-10-1998 20-10-1998 20-10-1998 14-09-1999
US 5409693	A	25-04-1995	US 5574063 A US 5554647 A	12-11-1996 10-09-1996
DE 19807774	A	26-08-1999	EP 0945128 A	29-09-1999

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**  
Information on patent family members

Inte Application No  
**PCT/EP 00/04938**

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
DE 19807774 A		JP 11279167 A	12-10-1999
JP 11222412 A	17-08-1999	NONE	

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**



# VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

## PCT

REC'D 22 AUG 2001

WIPO PCT

### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

T-4



Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 6713Wiar9961	<b>WEITERES VORGEHEN</b> siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP00/04938	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 30/05/2000	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 04/06/1999
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK A61K7/42		
Anmelder BEIERSDORF AG et al.		

- Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.
- Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 5 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.
  - ☐ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).

Diese Anlagen umfassen insgesamt Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- I ☒ Grundlage des Berichts
- II ☐ Priorität
- III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V ☒ Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII ☒ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII ☒ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags  08/12/2000	Datum der Fertigstellung dieses Berichts  20.08.2001
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde:   Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter  Paloniemi Legland, R  Tel. Nr. +49 89 2399 7315 

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

**I. Grundlage des Berichts**

1. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)*):  
**Beschreibung, Seiten:**

1-28                      ursprüngliche Fassung

**Patentansprüche, Nr.:**

1-10                      ursprüngliche Fassung

2. Hinsichtlich der **Sprache**: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
- ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).

3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:

- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
- ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
- ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung,              Seiten:
- ☐ Ansprüche,                Nr.:
- ☐ Zeichnungen,              Blatt:

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

5. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

*(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen).*

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

**V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung**

**1. Feststellung**

Neuheit (N)	Ja: Ansprüche	10
	Nein: Ansprüche	1-9
Erfinderische Tätigkeit (ET)	Ja: Ansprüche	
	Nein: Ansprüche	1-10
Gewerbliche Anwendbarkeit (GA)	Ja: Ansprüche	1-10
	Nein: Ansprüche	

2. Unterlagen und Erklärungen  
**siehe Beiblatt**

**VII. Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung**

Es wurde festgestellt, daß die internationale Anmeldung nach Form oder Inhalt folgende Mängel aufweist:  
**siehe Beiblatt**

**VIII. Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung**

Zur Klarheit der Patentansprüche, der Beschreibung und der Zeichnungen oder zu der Frage, ob die Ansprüche in vollem Umfang durch die Beschreibung gestützt werden, ist folgendes zu bemerken:  
**siehe Beiblatt**

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

**Zu Punkt V**

**Begründete Feststellung nach Art. 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung**

Es wird auf das folgende Dokument verwiesen:

D1: US-A-5 882 658 (SIMON PASCAL ET AL) 16. März 1999 (1999-03-16)

In Anspruch 1 wird die Verwendung von Ascorbinsäure und/oder Ascorbylverbindungen und einem oder mehreren Flavonderivaten und/oder Flavanonderivaten zur Herstellung kosmetischer oder dermatologischer Zubereitung zur Prophylaxe oder Linderung des Sonnenbrandes beansprucht.

Dokument D1 offenbart eine Zusammensetzung für den Sonnenschutz der Haut. Diese Zusammensetzung enthält sowohl Ascorbylverbindungen als auch Flavonderivate (Bsp. 2). Der Gegenstand von Anspruch 1 ist somit nicht neu (Art. 33(2) PCT).

Die abhängigen Ansprüche 2-9 beziehen sich auf Merkmale, die aus D1 schon bekannt sind (Spalte 3-5).

In anspruch 10 wird die Verwendung von obiger Zusammensetzung beantragt, indem die Zusammensetzung zusätzlich 0,01-10 % von Komplexbildner enthält. Solche Mengen von Komplexbildner sind üblich und begründen deswegen keine erfinderische Tätigkeit (Art. 33(3) PCT).

**Zu Punkt VII**

**Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung**

Im Widerspruch zu den Erfordernissen der Regel 5.1 a) ii) PCT werden in der Beschreibung weder der in dem Dokument D1 offenbarte einschlägige Stand der Technik noch dieses Dokument angegeben.

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**



**Zu Punkt VIII**

**Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung**

Das Merkmal "...0,01..." in Anspruch 3 ist nicht gestützt durch die Beschreibung (S.14: "0,001"). In den Ansprüchen 9-10 hätte die Verweisung auf Anspruch 8 gerichtet sein sollen (Art. 6 PCT).

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

5

Applicant's or agent's file reference 6713Wiar9961	<b>FOR FURTHER ACTION</b> See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/EP00/04938	International filing date (day/month/year) 30 May 2000 (30.05.00)	Priority date (day/month/year) 04 June 1999 (04.06.99)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC A61K 7/42		
Applicant BEIERSDORF AG		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.

2. This REPORT consists of a total of 5 sheets, including this cover sheet.

☐ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).

These annexes consist of a total of \_\_\_\_\_ sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:

- I ☒ Basis of the report
- II ☐ Priority
- III ☐ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- IV ☐ Lack of unity of invention
- V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- VI ☐ Certain documents cited
- VII ☒ Certain defects in the international application
- VIII ☒ Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 08 December 2000 (08.12.00)	Date of completion of this report 20 August 2001 (20.08.2001)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

# INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP00/04938

## I. Basis of the report

1. This report has been drawn on the basis of *(Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to the report since they do not contain amendments.)*:

- ☐ the international application as originally filed.
- ☒ the description, pages 1-28, as originally filed,  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the demand,  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_,  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_.
- ☒ the claims, Nos. 1-10, as originally filed,  
 Nos. \_\_\_\_\_, as amended under Article 19,  
 Nos. \_\_\_\_\_, filed with the demand,  
 Nos. \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_,  
 Nos. \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_.
- ☐ the drawings, sheets/fig \_\_\_\_\_, as originally filed,  
 sheets/fig \_\_\_\_\_, filed with the demand,  
 sheets/fig \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_,  
 sheets/fig \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_.

2. The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages \_\_\_\_\_
- ☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings, sheets/fig \_\_\_\_\_

3. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

4. Additional observations, if necessary:

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

**V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement****1. Statement**

Novelty (N)	Claims	10	YES
	Claims	1-9	NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-10	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-10	YES
	Claims		NO

**2. Citations and explanations**

Reference is made to the following document:

D1: US-A-5 882 658 (SIMON PASCAL ET AL) 16 March  
1999 (1999-03-16).

Claim 1 lays claim to the use of ascorbic acid and/or ascorbyl compounds and one or more flavone derivatives and/or flavanone derivatives for producing a cosmetic or dermatological preparation for preventing or soothing sunburn.

Document D1 discloses a composition for protecting skin from the sun. Said composition contains both ascorbyl compounds and flavone derivatives (Example 2). The subject matter of Claim 1 is therefore not novel (PCT Article 33(2)).

Dependent Claims 2-9 concern features which are already known from D1 (columns 3-5).

Claim 10 lays claim to the use of the above composition, the composition containing, in addition, 0.01-10% complexing agent. Such quantities of complexing agent are common and

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**



therefore do not involve an inventive step (PCT  
Article 33(3)).

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

**VII. Certain defects in the international application**

The following defects in the form or contents of the international application have been noted:

Contrary to PCT Rule 5.1(a)(ii), the description does not cite document D1 nor the relevant prior art disclosed therein.

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

**VIII. Certain observations on the international application**

The following observations on the clarity of the claims, description, and drawings or on the question whether the claims are fully supported by the description, are made:

The feature "0.01..." in Claim 3 is not supported by the description (page 14: "0.001"). Claims 9-10 should refer to Claim 8 (PCT Article 6).

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

**VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT  
AM DEM GEBIET DES PATENTWESSENS**

# PCT

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts <b>6713Wiar9961</b>	<b>WEITERES VORGEHEN</b> siehe Mitteilung über die Übermittlung des internationalen Recherchenberichts (Formblatt PCT/ISA/220) sowie, soweit zutreffend, nachstehender Punkt 5
Internationales Aktenzeichen <b>PCT/EP 00/ 04938</b>	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) <b>30/05/2000</b>
(Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) <b>04/06/1999</b>	
Anmelder  <b>BEIERSDORF AG et al.</b>	

Dieser internationale Recherchenbericht wurde von der Internationalen Recherchenbehörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem Internationalen Büro übermittelt.

Dieser internationale Recherchenbericht umfaßt insgesamt 4 Blätter.



Darüber hinaus liegt ihm jeweils eine Kopie der in diesem Bericht genannten Unterlagen zum Stand der Technik bei.

**1. Grundlage des Berichts**

- a. Hinsichtlich der **Sprache** ist die internationale Recherche auf der Grundlage der internationalen Anmeldung in der Sprache durchgeführt worden, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.



Die internationale Recherche ist auf der Grundlage einer bei der Behörde eingereichten Übersetzung der internationalen Anmeldung (Regel 23.1 b)) durchgeführt worden.

- b. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale Recherche auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das



in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.



zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.



bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.



bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.



Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.



Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfaßten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

2. ☐ **Bestimmte Ansprüche haben sich als nicht recherchierbar erwiesen** (siehe Feld I).

3. ☐ **Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung** (siehe Feld II).

**4. Hinsichtlich der Bezeichnung der Erfindung**



wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.



wurde der Wortlaut von der Behörde wie folgt festgesetzt:

**5. Hinsichtlich der Zusammenfassung**



wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.



wurde der Wortlaut nach Regel 38.2b) in der in Feld III angegebenen Fassung von der Behörde festgesetzt. Der Anmelder kann der Behörde innerhalb eines Monats nach dem Datum der Absendung dieses internationalen Recherchenberichts eine Stellungnahme vorlegen.

6. Folgende Abbildung der **Zeichnungen** ist mit der Zusammenfassung zu veröffentlichen: Abb. Nr. \_\_\_\_\_



wi vom Anmelder vorgeschlagen



weil der Anmelder selbst keine Abbildung vorgeschlagen hat.



w il diese Abbildung die Erfindung besser kennzeichnet.



keine der Abb.

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**



**A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES**

IPK 7 A61K7/42 A61P17/16 A61K7/48

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

**B. RECHERCHIERTE GEBIETE**

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 A61K A61P

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

PAJ, EPO-Internal, CHEM ABS Data

**C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN**

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	US 5 882 658 A (SIMON PASCAL ET AL) 16. März 1999 (1999-03-16) Spalte 1, Zeile 42 - Spalte 1, Zeile 67; Ansprüche 1,12; Beispiele 1,2 ---	1,6
A	DE 42 43 363 A (KUEBLER ULRICH DR MED) 23. Juni 1994 (1994-06-23) Anspruch 1 ---	1
A	DE 42 27 806 A (FISCHER PHARMA LTD) 25. Februar 1993 (1993-02-25) Seite 2, Zeile 47 - Zeile 52; Ansprüche 1,4 ---	1
A	DE 43 39 486 A (BACKHAUS ERWIN) 24. Mai 1995 (1995-05-24) Spalte 1, Zeile 50 - Zeile 51; Anspruch 1 --- -/--	1



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

22. September 2000

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

29/09/2000

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Voyiazoglou, D

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	FR 2 666 226 A (THOREL JEAN NOEL) 6. März 1992 (1992-03-06) Ansprüche 1,2,4 ---	1
A	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1999, no. 10, 31. August 1999 (1999-08-31) & JP 11 124341 A (RISUBURAN:KK), 11. Mai 1999 (1999-05-11) Zusammenfassung ---	1
A	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 018, no. 061 (C-1160), 2. Februar 1994 (1994-02-02) & JP 05 279225 A (SUNTORY LTD), 26. Oktober 1993 (1993-10-26) Zusammenfassung ---	1
A	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1995, no. 09, 31. Oktober 1995 (1995-10-31) & JP 07 157494 A (KAO CORP), 20. Juni 1995 (1995-06-20) Zusammenfassung ---	1
A	WO 98 47534 A (KLINGE CO CHEM PHARM FAB ;STANISLAUS FRITZ (DE)) 29. Oktober 1998 (1998-10-29) Seite 13, Zeile 1 - Zeile 15; Ansprüche 14,15 ---	1
A	FR 2 723 316 A (THOREL JEAN NOEL) 9. Februar 1996 (1996-02-09) Ansprüche 1,2,7 ---	1
A	US 5 843 411 A (SHAFFER BURT ET AL) 1. Dezember 1998 (1998-12-01) Spalte 5, Zeile 15 - Zeile 25; Ansprüche 1,19 ---	1
A	WO 96 18379 A (BEIERSDORF AG) 20. Juni 1996 (1996-06-20) in der Anmeldung erwähnt Anspruch 1 ---	1
A	US 5 409 693 A (PERRICONE NICHOLAS V) 25. April 1995 (1995-04-25) Ansprüche 1,13 ---	1
P,X	DE 198 07 774 A (BEIERSDORF AG) 26. August 1999 (1999-08-26) Seite 1, Zeile 14 - Zeile 25; Ansprüche 1,6 ---	1,6
	---	
	---/---	

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P, A	<p>PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1999, no. 13, 30. November 1999 (1999-11-30) &amp; JP 11 222412 A (SHISEIDO CO LTD; SOGO PHARMACEUT CO LTD), 17. August 1999 (1999-08-17) Zusammenfassung -----</p>	1

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

# Request Form for Translation

PTO 2003-5224

S.T.I.C. Translations Branch

U. S. Serial No. : 09/980,388

Requester's Name: T.J. CRIARES

Phone No. : (703) 308-4607

Fax No. : (703) 746-6897

Office Location: CM-1 - 2A03

Art Unit/Org. : 1617

Group Director: Doll

Is this for Board of Patent Appeals? maybe

Date of Request: 8/25/03

Date Needed By: ASAP - 9/15/03

(Please do not write ASAP-indicate a specific date)

Equivalent  
Searching

Foreign Patents

Phone: 308-0881  
Fax: 308-0989  
Location: Crystal Plaza 3/4  
Room 2C01

## SPE Signature Required for RUSH:

### Document Identification (Select One):

\*\* (Note: Please attach a complete, legible copy of the document to be translated to this form) \*\*

1. ☒ Patent Document No. 96-18383  
Language Summary  
Country Code WO  
Publication Date \_\_\_\_\_  
No. of Pages \_\_\_\_\_ (filled by STIC)

2. ☐ Article Author \_\_\_\_\_  
Language \_\_\_\_\_  
Country \_\_\_\_\_

3. ☐ Other Type of Document \_\_\_\_\_  
Country \_\_\_\_\_  
Language \_\_\_\_\_

### Document Delivery (Select Preference):

☐ Delivery to Exmr. Office/Mailbox Date: 8.26.03 (STIC Only)

☐ Call for Pick-up Date: \_\_\_\_\_ (STIC Only)

To assist us in providing the most cost effective service, please answer these questions:

Will you accept an English Language Equivalent?  
Yes (Yes/No)

Will you accept an English abstract?  
No (Yes/No)

Would you like a consultation with a translator to review the document prior to having a complete written translation?  
No (Yes/No)

Check here if Machine Translation is not acceptable:  
(It is the default for Japanese Patents, '93 and onwards with avg. 5 day turnaround after receipt)

## STIC USE ONLY

Copy/Search Processor: OK  
Date assigned: \_\_\_\_\_  
Date filled: \_\_\_\_\_  
Equivalent found: \_\_\_\_\_ (Yes/No)

Doc. No.: 2003/0142012  
Country: U.S.

Remarks: \_\_\_\_\_

Translation Date logged in: 8.26.03  
PTO estimated words: \_\_\_\_\_  
Number of pages: \_\_\_\_\_  
In-House Translation Available: \_\_\_\_\_  
In-House: \_\_\_\_\_ Contractor: \_\_\_\_\_  
Translator: \_\_\_\_\_ Name: \_\_\_\_\_  
Assigned: \_\_\_\_\_ Priority: \_\_\_\_\_  
Returned: \_\_\_\_\_ Sent: \_\_\_\_\_  
Returned: \_\_\_\_\_

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**